(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2005 年3 月10 日 (10.03.2005)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 2005/020882 A2

(51) 国際特許分類7:

A61K

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/012768

(22) 国際出願日:

2004年8月27日(27.08.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2003-306088 2003 年8 月29 日 (29.08.2003) JP 特願2004-110573 2004 年4 月2 日 (02.04.2004) JP 特願2004-169958 2004 年6 月8 日 (08.06.2004) JP 特願2004-198523 2004 年7 月5 日 (05.07.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府 大阪市 中央区道修町 2 丁目 1 番 5 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

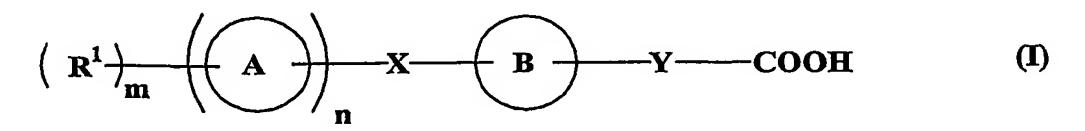
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中出 眞嗣 (NAKADE,Shinji) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市 和台 17番地 2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 水野弘貴 (MIZUNO,Hirotaka) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市和台 17番地 2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 小野岳児 (ONO,Takeji) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市和台 17番地 2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 南 真志 (MINAMI,Masashi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市和台 17番地 2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 佐賀 寛 (SAGA,Hiroshi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市和台 17番地 2 小野薬品工業株

式会社内 Ibaraki (JP). 萩谷 洋 (HAGIYA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市 和台 1 7 番地 2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 小宮 貴 樹 (KOMIYA, Takaki) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つ くば市 和台17番地2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 巾下 広 (HABASHITA, Hiromu) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井三丁目 1 番 1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 倉田 晴 登 (KURATA, Haruto) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三 島郡 岛本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株式 会社内 Osaka (JP). 大槻 和裕 (OHTSUKI, Kazuhiro) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井三丁目 1番 1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 久須 美健介 (KUSUMI, Kensuke) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪 府 三島郡 島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工 業株式会社内 Osaka (JP).

- (74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE, Kunihisa); 〒103-0013 東京都 中央区 日本橋人形町 2 丁目 1 4番 6号 セルバ人形町 6階 大家特許事務所 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,

[続葉有]

- (54) Title: COMPOUND CAPABLE OF BINDING S1P RECEPTOR AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF
- (54) 発明の名称: S 1 P 受容体結合能を有する化合物およびその医薬用途



(57) Abstract: A compound capable of binding S1P receptors (especially EDG-6, preferably EDG-1 and EDG-6). For example, a compound of the general formula (I), its salt or solvate, or a prodrug thereof is capable of binding S1P receptors (especially EDG-6, preferably EDG-1 and EDG-6) and is thus useful in the prevention and/or treatment of immunological reaction to transplant, graft versus host disease, autoimmune disease, allergosis, etc. (I) (wherein the ring A is a cyclic group; the ring B is an optionally substituted cyclic group; X is a spacer with a main chain of 1 to 8 atoms, etc.; Y is a spacer with a main chain of 1 to 10 atoms, etc.; and n is 0 or 1 provided that when n is 0, m is 1 and R¹ is a hydrogen atom or a substituent and that when n is 1, m is 0 or an integer of 1 to 7 and R¹ is a substituent, in which when m is 2 or greater, R¹s may be identical with or different from each other).

WO 2005/020882 A2

CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

国際調査報告書なし;報告書を受け取り次第公開される。

(57) 要約:

S1P受容体(特にEDG-6、好ましくはEDG-1およびEDG-6) 結合能を有する化合物、例えば一般式(I)で示される本発明化合物、その塩、その溶媒和物、またはそれらのプロドラッグはS1P受容体(特にEDG-6、好ましくはEDG-1およびEDG-6)結合能を有し、移植に対する拒絶反応、移植片対宿主病、自己免疫性疾患、アレルギー性疾患等の予防および/または治療に有用である。

$$\left(\begin{array}{c} R^1 \\ \end{array}\right)_{m} \left(\begin{array}{c} A \\ \end{array}\right)_{n} X - \left(\begin{array}{c} B \\ \end{array}\right)_{n} Y - COOH$$
 (I)

(式中、環Aは環状基;環Bは置換基を有していてもよい環状基;Xは主鎖の原子数 $1\sim8$ のスペーサー等;Yは主鎖の原子数 $1\sim1$ 0のスペーサー等;nは0、1;nが0の場合、mは1、かつR1は水素原子、置換基;nが1の場合、mは0、 $1\sim7$ の整数、かつR1は置換基、かつmが2以上のときR1は同じでも異なっていてもよい)。